

© WPI / Thomson

- AN - 1994-284288 [35]
TI - New benzimidazolium per:iodide and methyl-substd. derivs. - are antimicrobial agents active against E. coli etc., useful in medicine
AB - The benzimidazolium periodides of formula (I) are new. R1,R2 = H or CH3.
- USE :
- (I) are useful in medical practice.
- ADVANTAGE :
The low-toxicity cpds. exhibit greater antimicrobial effects w.r.t. several test strains than iodine soln. or certain antibiotics.
IW - NEW BENZIMIDAZOLIUM PER IODIDE METHYL SUBSTITUTE DERIVATIVE ANTIMICROBIAL AGENT
ACTIVE COLI USEFUL MEDICINE
PN - RU2009132 C1 19940315 DW199435
IC - C07D235/08; A61K31/415
MC - B05-C07 B06-D05 B14-A01 B14-A01A3
DC - B02
PA - (NCAU-R) N CAUCASUS AREA VETERINARY INST
IN - FETISOV L N; ZUBENKO A A
AP - SU19925037408 19920422
PR - SU19925037408 19920422



(19) RU⁽¹¹⁾ 2 009 132⁽¹³⁾ C1
(51) МПК⁵ C 07 D235/08, A 61 K 31/415

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21), (22) Заявка: 5037408/04, 22.04.1992

(46) Дата публикации: 15.03.1994

(71) Заявитель:
Северо-Кавказский зональный
научно-исследовательский ветеринарный
институт

(72) Изобретатель: Зубенко А.А.,
Фетисов Л.Н.

(73) Патентообладатель:
Северо-Кавказский зональный
научно-исследовательский ветеринарный
институт

(54) ПЕРИОДИДЫ БЕНЗИМИДАЗОЛИЯ, ОБЛАДАЮЩИЕ АНТИМИКРОБНЫМ ДЕЙСТВИЕМ

(57) Реферат:

Использование: в качестве соединений,
обладающих антимикробным действием.
Сущность изобретения: продукт общей
формулы I, где $R_1 - H, CH_3$; $R_2 - H, CH_3$, при
уловии, что 1a - $R_1 = R_2 - H$, 1б $R_1 - H$,
 $R_2 - CH_3$ 1a - $R_1 = R_2 - CH_3$, обладающие

антимикробным действием. Формула (I)



RU 2 009 132 C1

RU 2 009 132 C1



(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 009 132** ⁽¹³⁾ **C1**
 (51) Int. Cl.⁵ **C 07 D235/08, A 61 K 31/415**

RUSSIAN AGENCY
 FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21), (22) Application: 5037408/04, 22.04.1992

(46) Date of publication: 15.03.1994

(71) Applicant:
 SEVERO-KAVKAZSKIY ZONAL'NYJ
 NAUCHNO-ISSLEDOVATEL'SKIY
 VETERINARNYJ INSTITUT

(72) Inventor: ZUBENKO A.A.,
 FETISOV L.N.

(73) Proprietor:
 SEVERO-KAVKAZSKIY ZONAL'NYJ
 NAUCHNO-ISSLEDOVATEL'SKIY
 VETERINARNYJ INSTITUT

(54) PERIODIDE BENZIMIDAZOLYL, POSSESSING ANTIMICROBIAL ACTION

(57) Abstract:
 FIELD: medicine. SUBSTANCE: desired
 product has common

formula



where $R_1 = H$,

CH_3 ; $R_2 = H, CH_3$ if $R_1 = R_2 = H, R_1 = H$;
 $R_2-CH_3 - R_1 = R_2 = CH_3$. EFFECT: improves
 desired product quality.

RU 2 009 132 C1

RU 2 009 132 C1

Патент ФРГ N 2059379, CA 75, кл. 89198 f, 1971.

Патент Великобритании N 1265912, CA 76, кл. 158358 в, 1972.

Авторское свидетельство СССР N 770021, кл. C 07 D 235/08, 1979.

Формула изобретения:

Периодиды бензимидазолия общей формулы



5

где $R_1=H, CH_3$;

$R_2=H, CH_3$ при условии, что $R_1= R_2= H$,

или $R_1=H, R_2= CH_3$, или $R_1= R_2= CH_3$,

обладающие антимикробным действием.

10

15

20

25

30

35

40

45



50

55

60


Т а б л и ц а 1

Бактерицидная активность предлагаемых соединений (экспозиция 3 ч, бактериальная нагрузка 0,5 млн/мл)

Препарат	Тест-культура	Концентрация вещества, мкг/мл									Контроль культуры	Контроль среды
		100	50	25	12,5	6,25	3,12	1,56	0,78	0,39		
№ 65 	E.coli	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-
	Ps. aeruginosd	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-
	St.aureus	-	-	-	-	-	-	-	+	+	+	-
	E.coli	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-
	Ps. aeruginosd	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-
	St.aureus	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-
№ 66 	E.coli	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-
	Ps. aeruginosd	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-
	St.aureus	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-
	E.coli	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-
	Ps. aeruginosd	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-
	St.aureus	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-

RU 2 0 0 9 1 3 2 C 1





RU 2 0 0 9 1 3 2 C 1

Препарат	Тест-культура	Концентрация вещества, мкг/мл									Контроль культуры	Контроль среды
		100	50	25	12,5	6,25	3,12	1,56	0,78	0,39		
№ 71 	E.coli	-	-	-	-	-	+	+	+	+	+	-
	-	-	-	-	-	-	+	+	+	+	+	-
	-	-	-	-	-	+	+	+	+	+	+	-
	Ps. aeruginosd	-	-	-	-	-	+	+	+	+	+	-
	-	-	-	-	-	-	+	+	+	+	+	-
St.aureus	-	-	-	-	-	-	-	-	+	+	+	-
	-	-	-	-	-	-	-	-	+	+	+	-

Обозначения: "-" – отсутствие роста культуры бактерий;
 "+" – наличие роста культуры бактерий.

Таблица 2

Сравнительная бактерицидная активность периодидов бензимидазолия, известных препаратов йода и некоторых антибиотиков

Препарат	Минимальная бактерицидная концентрация в-в, мкг/мл		
	E.coli	St.dureus	Ps.deruginosd
№ 65 	6,25-12,5	0,78	1,56
№ 66 	12,5	6,25	12,5
№ 71 	6,25-12,5	1,56	6,25
Триодид бензимидазолия формулы 	10,0	1-10	1-10




Препарат	Минимальная бактерицидная концентрация в-в, мкг/мл		
	E.coli	St.dureus	Ps.deruginos
Йодинол*	16,0	16-32	15-25
Раствор йода*	16-64	64,0	16-32
Канамидина сульфат	100,0	3-6	25-50
Полимиксин	0,19	100**	0,1-1**
Левомитин	100,0	1,5-50**	100**
Неовитин	100,0	0,4-10**	3-200**
Окситетрациклина гидрохлорид	100,0	1,6-100**	100**

*По данным Мохнач В.О. в кн.: Йод и проблемы жизни. Л.: Наука. 1974. - С.83-93

**По данным справочника Рациональная антибиотикотерапия. Навашин С.М., Фомина И.П., М.: Медицина. -1982.-496с.

Таблица 3

*Острая токсичность периодидов бензимидазоля в сравнении с раствором йода в йодиде калия

Препарат	Доза, г/кг	Срок наблюдения дни	Кол-во животных в группе	Количество живых крыс к концу срока наблюдения
№ 65 	1,5	10	6	3
№ 66 	1,5	10	6	6
№ 71 	1,5	10	6	6
Раствор йода в йодиде калия	0,3	10	6	6
	0,6	10	6	3
	0,9	3	6	0